

B3

COMPOSITION FOR ORAL CAVITY

Patent number: JP63060917
Publication date: 1988-03-17
Inventor: SASO KAZUO
Applicant: LION CORP
Classification:
- international: A61K7/16
- european: A61K8/39; A61K8/44; A61Q11/00
Application number: JP19860206410 19860902
Priority number(s): JP19860206410 19860902

Also published as:

 US4865839 (A1)**Abstract of JP63060917**

PURPOSE: To produce a composition for the oral cavity, containing a specific polyglycerol monoester of a fatty acid as an active ingredient, having high safety, excellent feeling of use, e.g. foaming property, taste, etc., as well as good preservation stability with hardly any irritancy to mucous membranes.

CONSTITUTION: A composition for the oral cavity containing a polyglycerol monoester of a fatty acid having >=6 glycerol polymerization degree, 10-20 number of carbon atoms of the fatty acid, preferably 6-10 polymerization degree and 12-18C acyl group as the fatty acid as an active ingredient and preferably an N-acylamino acid or salt thereof together. In use, the composition is blended in a composition for the oral cavity, e.g. toothpaste, liquid dentifrice, etc. The amount of the blended active ingredient is preferably within the range of 0.5-3wt% and the amount of the blended N-acylamino acid, etc., is preferably within the range of 0.1-2wt%. The amount thereof used together with the polyglycerol monoester of the fatty acid which is the active ingredient is preferably 1-20pts.wt. based on 1-50pts.wt. active ingredient.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

⑨ 日本国特許庁 (JP) ⑩ 特許出願公開
⑪ 公開特許公報 (A) 昭63-60917

⑤Int.Cl.⁴
A 61 K 7/16

識別記号 庁内整理番号
6971-4C

⑥公開 昭和63年(1988)3月17日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全 7 頁)

⑦発明の名称 口腔用組成物

⑧特 願 昭61-206410
⑨出 願 昭61(1986)9月2日

⑩発明者 佐 相 一 夫 神奈川県平塚市南原2-10-31
⑪出願人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号
⑫代理人 弁理士 小島 隆司

明細書

1. 発明の名称

口腔用組成物

2. 特許請求の範囲

1. グリセリン重合度が6以上であり、脂肪酸の炭素数が10~20であるポリグリセリン脂肪酸モノエステルを配合したことを特徴とする口腔用組成物。

2. ポリグリセリン脂肪酸モノエステルの配合量が0.5~5重量%である特許請求の範囲第1項記載の口腔用組成物。

3. ポリグリセリン脂肪酸モノエステルにN-アシルアミノ酸又はその塩を併用した特許請求の範囲第1項又は第2項記載の口腔用組成物。

4. N-アシルアミノ酸のアシル基が炭素数8~20であり、アミノ酸がグルタミン酸、サルコシン又はN-メチル-L-アラニンである特許請求の範囲第3項記載の口腔用組成物。

5. ポリグリセリン脂肪酸モノエステル1~

50重量部に対しN-アシルアミノ酸又はその塩を1~2重量部の割合で併用した特許請求の範囲第3項又は第4項記載の口腔用組成物。

6. N-アシルアミノ酸又はその塩の配合量が0.1~2重量%である特許請求の範囲第3項乃至第5項のいずれか1項に記載の口腔用組成物。

3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルを含有した口腔用組成物に関する。

従来の技術及び発明が解決しようとする問題点

口腔用組成物には、その清浄力を高めるために界面活性剤が配合されているが、その界面活性剤に更に要求される特性としては、口腔内で使用されるものであるから、優れた発泡性を有し、苦味、渋味、その他の不快な味や臭いがしない等、良好な使用感を有し、かつ高い安全性を有するものが望ましい。また、長期間の保存にも十分耐え、変質(変色、成分離等)を起こさないことも重要な特性の一つである。

従来、口腔用組成物に使用されている界面活性剤にはアニオン界面活性剤と非イオン界面活性剤がある。これらのうち、アニオン界面活性剤は優れた発泡性を示すために広く使用されており、特にラウリル硫酸ナトリウムが従来より常用されているが、ラウリル硫酸ナトリウムはジュース効果の点で劣る上、酵素類等の安定化配合の上でも問題がある。また、非イオン界面活性剤は、安全性、有効成分の安定化やジュース効果などの面ではアニオン界面活性剤より優れているが、従来使用されている非イオン界面活性剤には発泡性が劣ったり、味、臭いの面で問題のあるものが多い。たとえば、ショ糖ラウリン酸エステル、ショ糖ミリスチン酸エステルは比較的泡立ちが良好であるが、苦味が強いという欠点を有する。またショ糖脂肪酸エステルを適度に配合した場合、長期間又は高温（夏場店頭など）に晒したときに黄色く変色し、更に液分離を起こし、使用に耐えないものとなってしまう欠点もある。

このため、使用感（泡立ち、味）が良く、ジュ

脂肪酸エステルを使用した場合に比較して苦味、渋味など味の点で大幅に改良されて、優れた使用感を与える、更に高温で長期間保存しても変色がなく、保存安定性も良好であることを見出し、それ故、かかるポリグリセリン脂肪酸モノエステルを口腔用組成物に配合すると、使用感や安定性に優れ、有効成分を安定に保持し得ることを知見した。

更に、かかるポリグリセリン脂肪酸モノエステルとN-アシルアミノ酸又はその塩とを併用して口腔用組成物に配合すると、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルの発泡性が更に高まることも知見し、本発明をなすに至った。

従って、本発明はグリセリン重合度が6以上であり、脂肪酸の炭素数が10～20であるポリグリセリン脂肪酸モノエステルを含有する口腔用組成物を提供するものである。

以下、本発明につき更に詳しく説明する。

本発明は、練歯磨、粉歯磨、液状歯磨、潤性歯磨、マウスウォッシュ等の口腔用組成物中にポリグリセリン脂肪酸モノエステルを配合するもので

ース効果に優れ、更に安定性が良好で高温で長期間保存しても変色がなく、しかも使用上安全性の高い口腔用組成物に適した界面活性剤の開発が要望されていた。

本発明は上記事情に鑑みなされたもので、清浄力を高めるという界面活性剤本来の性質に加え、安全性が高く、粘膜刺激性が少ないと、発泡性、味、臭いなどの使用感、ジュース効果および安定性のいずれもが良好である上、有効成分の安定化配合を可能とする等、口腔用組成物に適した界面活性剤を提供することを目的とする。

問題点を解決するための手段及び作用

本発明者は、上記目的を達成するため、口腔用組成物用の界面活性剤について鋭意検討を重ねた結果、グリセリン重合度が6以上であり、脂肪酸の炭素数が10～20であるポリグリセリン脂肪酸モノエステルが界面活性剤として高い清浄力を有し、良好な発泡力を有すると共に、安全性が高く、粘膜刺激性が少ないと、酵素等の安定配合効果が高く、更にジュース効果に優れ、またショ糖

ある。

ここで用いられるポリグリセリン脂肪酸モノエステルは、グリセリンと脂肪酸とから製造することができるが、本発明で使用されるポリグリセリン脂肪酸モノエステルはグリセリン重合度が6以上のもの、より好ましくは6～10のものを用いる。グリセリン重合度が6より小さいものは、泡立ちが悪く、口腔用組成物用として不適である。

また、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルの脂肪酸としては、そのアシル基が直鎖でも分枝状でもよいが、炭素数が10～20のものを用いるもので、特に炭素数12～18のアシル基が好適である。炭素数が10より少ないもの及び20より多いものは発泡性や味等が劣り、本発明の目的を達成し得ない。具体的には、ラウロイル、ミリスチル、ステアロイル、オレオイル等の飽和もしくは不飽和のアシル基が例示され、これらは単独でも混合物であってもよい。

本発明において、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルは、モノエステルを使用するものであり、

ジエステル等では泡立ちや味が悪く、本発明の目的を達成することができない。なおこの場合、本発明において、モノエステルとしては平均エステル化度が1.4以下のものを包含するが、特に平均エステル化度が1.3以下のものが好適である。

上述したようなポリグリセリン脂肪酸モノエステルとして、具体的には、ヘキサグリセリンモノミリステート、デカグリセリンモノミリステート、ヘキサグリセリンモノラウレート、デカグリセリンモノラウレート、ヘキサグリセリンモノステアレート、デカグリセリンモノオレエート等が例示され、これらは単独で又は2種以上を併用して用いることができる。

また、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルの配合量は、口腔用組成物中に好ましくは0.5~5重量%、より好ましくは0.5~3重量%である。

本発明においては、界面活性剤としてポリグリセリン脂肪酸モノエステルを単独で使用することもできるが、必要に応じて他の界面活性剤、例えばアルキルサルフェート、オレフィンスルホネー

ト、N-アシルアミノ酸及びその塩、モノグリセリドサルフェート、石鹼などのアニオン界面活性剤、脂肪酸モノグリセリド、脂肪酸アルキロールアミド、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤、両性界面活性剤等の1種又は2種以上を組合せて用いることもできる。

これらの中では、特にN-アシルアミノ酸又はその塩を前記ポリグリセリン脂肪酸モノエステルと併用することが好ましく、このようにN-アシルアミノ酸又はその塩とポリグリセリン脂肪酸モノエステルとを併用することにより、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルの発泡力が更に高まり、優れた発泡性を有し、使用感のより良好な口腔用組成物を得ることができる。

ここで、N-アシルアミノ酸としては、N-長鎖アシルアミノ酸、特に炭素数8~20の飽和もしくは不飽和のアシル基を有するもの、具体的にはラウロイル基、ミリストイル基、ステアリル基、ヤシ油脂肪酸残基、硬化牛脂脂肪酸残基、或いは

これらの混合脂肪酸残基などが好適に用いられる。また、そのアミノ酸の種類に何ら制限はないが、グルタミン酸、サルコシン、N-メチル-β-アラニン等を単独で又は2種以上を併用して用いることが好ましい。具体的には、N-アシルアミノ酸として、N-ミリストイルグルタメート、N-ラウロイルグルタメート、N-ミリストイルサルコシネート、N-ラウロイルサルコシネート、N-ラウロイルメチル-N-β-アラニート等を挙げることができる。また、N-アシルアミノ酸の塩としてはナトリウム塩、カリウム塩等が挙げられる。なお、N-アシルアミノ酸として例えばジカルボン酸のものを使用する場合、塩としては水溶性塩であればモノ金属塩でもジ金属塩でもよい。

N-アシルアミノ酸又はその塩の配合量は、特に制限されるものではないが、0.1~2重量%が好適であり、またポリグリセリン脂肪酸モノエステルとの併用割合は、ポリグリセリン脂肪酸モノエステル1~50重量部に対してN-アシルアミノ酸又はその塩を1~2重量部とすることが好

ましい。

本発明の口腔用組成物は、その種類に応じて種々の公知の成分を用いることができる。例えば歯磨類には第2リン酸カルシウム、炭酸カルシウム、ピロリン酸カルシウム、不溶性メタリン酸ナトリウム、無水ケイ酸等の研磨剤、グリセリン、ソルビット、プロビレングリコール、ポリエチレングリコール等の粘稠剤、カルボキシメチセルロース、カラゲナン、アルギン酸ナトリウム、ビーガム、ヒドロキシエチルセルロース、ポリビニルアルコール等の粘結剤、サッカリンナトリウム、グリチルリチン塩類、ステビオサイド、ネオヘスペリジルジヒドロカルコン、パラメトキシシンナミックアルデヒド、ペリラルチン等の甘味剤、メントール、カルボン、アнетール等の香料などが使用され、更にモノフルオロリン酸ナトリウム、フッ化スズ、フッ化ナトリウム等のフッ化物、クロルヘキシジン塩類等の殺菌剤、リン酸ナトリウム等のリン酸化合物、デキストラナーゼ、アミラーゼ等の酵素、L-アミノカプロン酸、トラネキサ

ム酸、アラントイネート等の抗炎症剤などの有効成分が適宜使用される。

また、マウスウォッシュ等の口腔洗浄剤においても、各製品の性状に応じた成分が適宜配合される。

この場合、本発明においては、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルが酵素等の有効成分を失活させ難いので、これら酵素等の有効成分を支障なく配合し得る。

発明の効果

本発明の口腔用組成物は、特定のポリグリセリン脂肪酸モノエステルを使用したことにより、安全性が高く、粘膜刺激性が少なく、更に発泡性や味などの使用感やジュース効果が良好である。また、保存安定性にも優れ、長期間保存しても変色等が生じ難く、しかも殺菌剤、酵素、フッ素化合物等のイオン性有効成分を安定に配合することができるので、使用時にその機能を十分に發揮させることができる。

以下に実験例により本発明の効果を具体的に示

す。なお、下記の例において%はいずれも重量%である。

[実験例 1]

第1表に示す発泡剤（界面活性剤）を用い、下記处方の歯磨組成物を調製した。これら歯磨組成物の使用感と安定性を下記基準にて評価した。

結果を第1表に示す。

歯磨組成物处方	(単位: %)
第2リン酸カルシウム	4.5.0
無水ケイ酸	3.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	0.8
カラゲナン	0.2
ソルビット液	26.0
プロピレングリコール	3.0
サッカリンナトリウム	0.2
香 料	1.0
発 泡 剤	2.0
防 腐 剤	0.1
精 調 水	残
	計 100.0

泡立ち評価基準

- : 適度な泡立ちあり。
- △ : やや泡立ちあり。
- × : ほとんど泡立たない。

味の評価基準

- : 良好。
- △ : やや苦味あり。
- × : 苦味が強く使用に耐えない。

安定性評価基準 (50℃, 1ヶ月保存後)

- 変色 ○ : 変色なし。
- △ : やや変色あり。
- × : 変色が激しい。

第 1 表

	発 泡 剂	使用感		安定性
		泡立ち	味	
本 発 明 歯 磨	No.1 デカグリセリンモノラウレート	○	○	○
	No.2 ヘキサグリセリンモノミリストート	○~△	○	○
比 較 歯 磨	No.3 デカグリセリンジオレエート	×	×	△
	No.4 テトラグリセリンモノステアレート	×	○	○
	No.5 シュ糖モノラウレート	○	△~×	△~×

次に、第1表に示す歯磨組成物No.1（発泡剤：デカグリセリンモノラウレート、本発明歯磨）と歯磨組成物No.5（発泡剤：シュ糖モノラウレート、比較歯磨）の使用感につき、一般パネル10名により一对比較の官能検査を実施した。

結果を第2表に示す。

第 2 表

		No.5よりNo.1の歯磨が優れていると答えたパネル	No.1とNo.5の歯磨が同程度と答えたパネル	No.1よりNo.5の歯磨が優れていると答えたパネル
使用感	泡立ち	3人	5人	2人
	味	6人	4人	0人

以上の結果より、グリセリン重合度が6以上のポリグリセリン脂肪酸モノエステルを配合した本発明の歯磨組成物は、適度な泡立ちと良好な味を有する上、変色もなく、使用感と安定性に優れていることが認められ、またショ糖モノラウレートを配合した歯磨組成物とを比較しても、泡立ちは同程度であるが、味が良いことが認められた。

〔実験例2〕

第3表に示す発泡剤を用いた以外は実験例1と同様の処方の歯磨組成物を調製した。これら歯磨組成物の味及び安定性（変色）を実験例1と同様の基準にて評価し、また、泡立ち及びジュース効果を下記基準にて評価した。

結果を第3表に示す。

泡立ち評価基準

次に、第3表に示す歯磨組成物No.1（発泡剤：デカグリセリンモノラウレート）と歯磨組成物No.6（発泡剤：デカグリセリンモノラウレート+N-ラウロイルサルコシンエート）の使用感につき、一般パネル10名により一対比較の官能評価を行なった。

結果を第4表に示す。

第 4 表

		No.5よりNo.1の歯磨が優れていると答えたパネル	No.1とNo.6の歯磨が同程度と答えたパネル	No.1よりNo.6の歯磨が優れていると答えたパネル
使用感	泡立ち	0人	2人	8人
	味	2人	6人	2人

第3・4表の結果から明らかのように、発泡剤としてポリグリセリン脂肪酸モノエステルを単独で配合したもの（No.1）に比べ、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルとN-アシルアミノ酸類とを併用した歯磨組成物（No.6, 7, 8）は、味や変色は同程度であったが、泡立ちが非常に良いことが認められた。また、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルは、ジュースの味をほとんど変え

◎： 良好的な泡立ちあり。

○： 適当な泡立ちあり。

△： やや泡立ちあり。

×： ほとんど泡立たない。

ジュース効果評価基準

○： ジュースの味を変えることなく、良好

×： ジュースの味を変え、不良

第 3 表

		発泡剤（配合量）	使用感		安定性
本発明歯磨	No.1		泡立ち	味	
	No.6	デカグリセリンモノラウレート（2.0%） + N-ラウロイルサルコシンエート（0.5%）	○	○	○
	No.7	デカグリセリンモノラウレート（1.5%） + N-硬化牛脂ヤシ油混合脂肪酸グリセート（0.5%）	○	○	○
	No.8	デカグリセリンモノラウレート（1.5%） + N-ラウロイルスチル-β-アラニート（0.5%）	○	○	○

ることがなく、ジュース効果が良好であり、これにN-アシルアミノ酸類を併用してもジュース効果を阻害しないことが知見された。

〔実験例3〕

(単位: %)

水酸化アルミニウム	40.0
無水ケイ酸	2.0
プロピレングリコール	2.0
ソルビット液	15.0
グリセリン	15.0
アルギン酸ナトリウム	1.0
サッカリンナトリウム	0.2
デキストラナー	5000u/g
ゼラチン	0.2
モノフルオロリン酸ナトリウム	0.76
デカグリセリンモノミリステート	2.5
香 料	1.0
防 腐 剂	微量
精 製 水	残
計	100.0

上記処方にて調製した歯磨を40℃で1ヶ月

間保存し、デキストラナーゼ残存活性を評価した。

その結果、デキストラナーゼ残存率は調製時に對し70%以上であり、ポリグリセリン脂肪酸モノエステルは酵素デキストラナーゼの活性を阻害せず、これを安定に保持することが確認された。

以下、実施例を示し、本発明を具体的に説明するが、本発明は下記の実施例に制限されるものではない。

〔実施例1〕 練歯磨		(単位: %)
アルミノシリケート		20.0
グリセリン		15.0
ソルビット液		40.0
ポリエチレングリコール#400		4.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム		1.2
サッカリンナトリウム		0.2
ヘキサグリセリンモノステアレート		2.0
N-ラウロイルグルタメート		0.5
香 料		1.0
色 素		微量
グルコン酸クロルヘキシジン		0.01

〔実施例2〕 練歯磨		(単位: %)
ソルビット液		25.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム		0.8
カラゲナン		0.3
サッカリンナトリウム		0.2
ヘキサグリセリンモノミリストート		2.0
ショ糖モノミリストート		1.0
アラントインクロルヒドロキシアルミニウム		0.1
香 料		1.0
防 腐 剤		微量
精 製 水		残

計 100.0

〔実施例3〕 練歯磨		(単位: %)
ジルコノシリケート		15.0
無水ケイ酸		2.0
ポリエチレングリコール#400		3.0
ソルビット液		60.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム		1.4
サッカリンナトリウム		0.2
デカグリセリンモノラウレート		1.5
N-ミリストイルグルタメート		1.0

精 製 水		残
計		100.0
〔実施例2〕 練歯磨	(単位: %)	
炭酸カルシウム(重質)		30.0
炭酸カルシウム(軽質)		15.0
プロピレングリコール		3.0
ソルビット液		30.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム		1.0
サッカリンナトリウム		0.1
トラネキサム酸		0.1
デカグリセリンモノラウレート		1.0
N-ラウロイル-N-メチル-β-アラニート		1.0
香 料		1.0
防 腐 剤		微量
精 製 水		残

計 100.0

〔実施例4〕 練歯磨		(単位: %)
ジルコノシリケート		15.0
無水ケイ酸		2.0
ポリエチレングリコール#400		3.0
ソルビット液		60.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム		1.4
サッカリンナトリウム		0.2
デカグリセリンモノラウレート		1.5
N-ミリストイルグルタメート		1.0

精 製 水		残
計		100.0
〔実施例5〕 練歯磨	(単位: %)	
水酸化アルミニウム		35.0
酸化アルミニウム		2.0
プロピレングリコール		3.0
ソルビット液		15.0
グリセリン		5.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム		1.2
サッカリンナトリウム		0.1
塩化ナトリウム		10.0
デカグリセリンモノオレエート		1.5
N-ミリストイルサルコシネート		0.5
イソプロピルメチルフェノール		0.05
香 料		1.0

精製水	残
計	100.0
〔実施例6〕 滴製歯磨	(単位: %)
第2リン酸カルシウム	35.0
炭酸カルシウム	40.0
グリセリン	10.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	0.3
サッカリンナトリウム	0.2
デカグリセリンモノラウレート	1.5
香 料	1.5
精製水	残
計	100.0
〔実施例7〕 マウスウォッシュ	(単位: %)
エタノール	10.0
グリセリン	10.0
ソルビット液	5.0
クエン酸	0.1
クエン酸ナトリウム	0.4
サッカリンナトリウム	0.05
ヘキサグリセリンモノラウレート	1.5

香 料	1.0
精製水	残
計	100.0

実施例1~7の口腔用組成物は、いずれも良好な使用感、安定性を有していた。

出願人 ライオン株式会社
代理人 弁理士 小島隆司